



①9 BUNDESREPUBLIK
DEUTSCHLAND



DEUTSCHES
PATENT- UND
MARKENAMT

⑫ **Offenlegungsschrift**
⑩ **DE 199 33 466 A 1**

⑤① Int. Cl.7:
A 61 K 7/48
A 61 K 7/40

⑦① Aktenzeichen: 199 33 466.8
⑦② Anmeldetag: 9. 7. 1999
④③ Offenlegungstag: 13. 1. 2000

DE 199 33 466 A 1

⑥⑥ Innere Priorität:
198 30 851. 5 10. 07. 1998
⑦① Anmelder:
Beiersdorf AG, 20253 Hamburg, DE

⑦② Erfinder:
Gers-Barlag, Heinrich, Dr., 25495 Kummerfeld, DE;
Pollet, Dieter, Dr., 22523 Hamburg, DE; Lehmann,
Jutta, 37154 Northeim, DE

Die folgenden Angaben sind den vom Anmelder eingereichten Unterlagen entnommen

Rechercheantrag gem. Paragraph 43 Abs. 1 Satz PatG ist gestellt

- ⑤④ Verwendung von Ectoinen als Antioxidantien oder Radikalfänger in kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen
- ⑤⑦ Verwendung von einer Verbindung oder mehreren Verbindungen aus der Gruppe der Ectoine als Antioxidantien und/oder als Radikalfänger.

DE 199 33 466 A 1

BEST AVAILABLE COPY

DE 199 33 466 A 1

Beschreibung

Die vorliegende Erfindung betrifft kosmetische und dermatologische Zubereitungen mit einem wirksamen Gehalt an Ectoinen oder deren Derivaten. Insbesondere betrifft die vorliegende Erfindung kosmetische Zubereitungen mit einem wirksamen Schutz vor schädlichen Oxidationsprozessen in der Haut, aber auch zum Schutze der topischen Zubereitungen selbst bzw. zum Schutze der Bestandteile der topischen Zubereitungen vor schädlichen Oxidationsprozessen.

Bei den im folgenden genannten erfindungsgemäßen kosmetischen und dermatologischen Zubereitungen handelt es sich um kosmetische oder dermatologische topische Zubereitungen mit einem Gehalt an mindestens einem Ectoin.

Die vorliegende Erfindung betrifft ferner Antioxidantien, bevorzugt solche, welche in hautpflegenden kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen eingesetzt werden. Insbesondere betrifft die Erfindung auch kosmetische und dermatologische Zubereitungen, solche Antioxidantien enthaltend. In einer bevorzugten Ausführungsform betrifft die vorliegende Erfindung kosmetische und dermatologische Zubereitungen zur Prophylaxe und Behandlung kosmetischer oder dermatologischer Hautveränderungen, insbesondere die, die durch oxidative und radikalische Prozesse hervorgerufen werden, insbesondere die Hautalterung.

Weiterhin betrifft die vorliegende Erfindung Wirkstoffe und Zubereitungen, solche Wirkstoffe enthaltend, zur kosmetischen und dermatologischen Behandlung oder Prophylaxe erythematöser, entzündlicher, allergischer oder autoimmunreaktiver Erscheinungen, insbesondere solcher Dermatosen, die mit radikalischen oder prooxidativen Prozessen verbunden sind.

Die vorliegende Erfindung betrifft ferner Wirkstoffkombinationen und Zubereitungen, die zur Prophylaxe und Behandlung der lichtempfindlichen Haut, insbesondere von Photodermatosen, dienen.

Es ist bekannt, daß bei entzündlichen Prozessen reaktive Sauerstoffspezies beteiligt sind, die zu Zellschäden führen können. Die mit den entzündlichen Prozessen einhergehenden erythematösen Hauterscheinungen treten auch als Begleiterscheinungen bei gewissen Hauterkrankungen oder -unregelmäßigkeiten auf. Beispielsweise ist der typische Hautausschlag beim Erscheinungsbild der Akne regelmäßig mehr oder weniger stark gerötet. Ferner sind an der Pathogenese verschiedener Dermatosen, wie insbesondere der Psoriasis und der Sclerodermie reaktive Sauerstoffspezies, insbesondere das Superoxidradikal, beteiligt. Sie treten hierbei als sogenannte clastogene, d. h. chromosomenbrechende Faktoren in Erscheinung (P. Filipe et al., Photochemistry and Photobiology 66 : 497-501, 1997; Ch. Auclair et al., Archives of Biochemistry And Biophysics 278 : 238-244, 1990).

Die schädigende Wirkung des ultravioletten Teils der Sonnenstrahlung (UV-Strahlung) auf die Haut ist allgemein bekannt. UV-Strahlung führt über unterschiedliche Mechanismen zur Entstehung von Schäden in der Haut.

Insbesondere UVA-Strahlung im Bereich von ca. 320 bis ca. 400 nm wird durch zelluläre Chromophoren wie Riboflavin, NAD-Koenzyme, Melanin usw. absorbiert, die dabei als endogene Photosensibilisatoren wirken. Die dadurch induzierten, großteils radikalischen ablaufenden Reaktionskaskaden führen vorwiegend zur Bildung reaktiver Sauerstoffspezies wie bspw. H_2O_2 , Hydroxylradikale und Singulett-Sauerstoff. Hierbei wird neben Lipiden und Proteinen insbesondere auch die DNS geschädigt. Typische DNS-Schäden nach UVA-Exposition sind Einzelstrangbrüche, oxidierte Basen wie 8.

Hydroxyguanin und DNA-Addukte. Solare UVB-Strahlung im Bereich von ca. 290 bis ca. 320 nm wird zwar vorwiegend direkt von der DNA absorbiert. Aber auch für diesen UV-Bereich werden prooxidative und radikalische Prozesse berichtet (bspw. D. Peus et al., Journal of Investigative Dermatology 110 : 966-971, 1998), die zu entsprechenden Zellschäden führen.

Ferner können auch undefinierte radikalische oder prooxidative Photoprodukte, welche in der Haut unter UV-Exposition infolge photochemischer Reaktionen entstehen, aufgrund ihrer hohen Reaktivität unkontrollierte Folgereaktionen bewirken und dadurch auch in den Hautmetabolismus eingreifen. Es ist erwiesen, daß insbesondere UVA-Strahlung zu einer Schädigung der elastischen und kollagenen Fasern des Bindegewebes führt, was die Haut vorzeitig altern läßt, und daß sie als Ursache zahlreicher phototoxischer und photoallergischer Reaktionen zu sehen ist.

Aufgabe der Erfindung war es daher auch, kosmetische, dermatologische und pharmazeutische Wirkstoffe und Zubereitungen sowie Lichtschutzformulierungen zu schaffen, die zur Prophylaxe und Behandlung lichtempfindlicher Haut, insbesondere von Photodermatosen, bevorzugt bei der Dermatitis solaris und der polymorphen Lichtdermatose (PLD, PLE, Mallorca-Akne und eine Vielzahl von weiteren Bezeichnungen, wie sie in der Literatur z. B. bei A. Voelckel et al. Zentralblatt Haut- und Geschlechtskrankheiten 156 : 2, 1989 angegeben sind) dienen.

Im Aufsatz "Skin Diseases Associated with Oxidative Injury" in "Oxidative Stress in Dermatology", S. 323 ff. (Marcel Decker Inc., New York, Basel, Hong Kong, Herausgeber: Jürgen Fuchs, Frankfurt, und Lester Packer, Berkeley/Californien), werden oxidative Schäden der Haut und ihre näheren Ursachen aufgeführt.

Um diesen prooxidativen oder radikalischen Reaktionen vorzubeugen, können den kosmetischen bzw. dermatologischen Formulierungen zusätzliche Antioxidantien und/oder Radikalfänger einverleibt werden. Zwar sind einige Antioxidantien und Radikalfänger bekannt. So ist bereits in den US-Patentschriften 4,144,325 und 4,248,861 sowie aus zahlreichen anderen Dokumenten vorgeschlagen worden, Vitamin E, eine Substanz mit bekannter antioxidativer Wirkung in Lichtschutzformulierungen einzusetzen, dennoch bleibt auch hier die erzielte Wirkung weit hinter der erhofften zurück.

Weiterhin werden Antioxidantien und Radikalfänger als Schutzsubstanzen gegen den Verderb der sie enthaltenden Zubereitungen verwendet. Entsprechende Substanzen, welche auch auf dem Gebiete der Kosmetik und der Pharmazie Verwendung finden, sind beispielsweise Vitamin E, insbesondere in Form des α -Tocopherylacetats, Vitamin C, insbesondere in Form des Ascorbylphosphats, Butylhydroxytoluol und andere. Sie verhindern Oxidationsprozesse, bspw. die Autoxidation ungesättigter Verbindungen enthaltender Lipide, können so aber auch zur Photostabilität insbesondere von UVabsorbierenden Bestandteilen der Zubereitungen beitragen. So werden bspw. in Sonnenschutzmitteln zum Schutz gegen die Strahlen des UVA-Bereichs gewisse Derivate des Dibenzoylmethans verwendet, deren Photostabilität nicht in ausreichendem Maße gegeben ist (Int. J. Cosm. Science 10 : 53 ff, 1988).

Soll menschliches Haar dauerhaft gefärbt werden, kommen in der Praxis lediglich oxidierende Haarfärbverfahren in Betracht. Beim oxidativen Haarfärben erfolgt die Ausbildung des Farbstoffchromophoren durch Reaktion von Präkurso-

DE 199 33 466 A 1

ren (Phenole, Aminophenole, seltener auch Diamine) und Basen (meistens p-Phenylendiamin) mit dem Oxidationsmittel, zumeist Wasserstoffperoxid. Wasserstoffperoxidkonzentrationen um 6% werden dabei gewöhnlich verwendet.

Üblicherweise wird davon ausgegangen, daß neben der Färbewirkung auch eine Bleichwirkung durch das Wasserstoffperoxid erfolgt. In oxidativ gefärbtem menschlichem Haar sind, ähnlich wie bei gebleichtem Haar, mikroskopische Löcher an den Stellen, an denen Melaningranula vorlagen, nachweisbar. Tatsache ist, daß das Oxidationsmittel Wasserstoffperoxid nicht nur mit den Farbstufen, sondern auch mit der Haarsubstanz reagieren und dabei unter Umständen eine Schädigung des Haares bewirken kann.

Eine Aufgabe der vorliegenden Erfindung war, die Nachteile des Standes der Technik zu beseitigen. Insbesondere sollten Wirkstoffe bzw. Zubereitungen, solche Wirkstoffe enthaltend, zur Verfügung gestellt werden, bei deren Verwendung die Schädigung der Haut und/oder des Haares durch oxidativen Einfluß zumindest gemindert, wenn nicht gänzlich verhindert werden können.

Eine weitere Aufgabe der vorliegenden Erfindung bestand darin, kosmetische Zubereitungen zur Verfügung zu stellen, welche vor oder nach Behandlung des Haars mit Haarfärb Zubereitungen, selbst solcher mit einem Gehalt an starken Oxidationsmitteln wie z. B. Wasserstoffperoxid, deren schädigenden Oxidationswirkung entgegenwirken.

Insbesondere sollten Wirkstoffe und Zubereitungen, solche Wirkstoffe enthaltend, zur kosmetischen und dermatologischen Behandlung und/oder Prophylaxe erythematöser, entzündlicher, allergischer oder autoimmunreaktiver Erscheinungen, insbesondere Dermatosen, aber auch des Erscheinungsbildes des "Stingings" zur Verfügung gestellt werden.

Es war indes überraschend und für den Fachmann nicht vorherzusehen, daß die Verwendung von Ectoinen als Antioxidantien und/oder als Radikalfänger in kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen den Nachteilen des Standes der Technik abhelfen.

Es war für den Fachmann auch nicht vorauszusehen gewesen, daß erfindungsgemäß verwendete Ectoine bzw. kosmetische oder dermatologische Zubereitungen, diese enthaltend:

- besser radikalfängend wirken
- besser antioxidativ wirken
- besser gegen die durch eingedrungene Fremdstoffe oder entzündliche Reaktionen oder UV-Strahlung hervorgerufenen radikalischen und prooxidativen Prozesse verursachten Schäden an zellulärer DNS, Lipide und Proteine schützen
- besser gegen die durch eingedrungene Fremdstoffe oder entzündliche Reaktionen oder UV-Strahlung hervorgerufenen radikalischen und prooxidativen Prozesse verursachten Immunreaktionen schützen
- besser der durch diese Prozesse vermittelten Hautalterung entgegenwirken
- besser entzündlichen Reaktionen vorbeugen würden

als die Wirkstoffe, Wirkstoffkombinationen und Zubereitungen des Standes der Technik. Ferner war nicht vorauszusehen gewesen, daß Ectoine in kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen höhere Stabilität aufweisen als vergleichbare Wirkstoffe, beispielsweise als Vitamin C.

Erfindungsgemäß werden die genannten Aufgaben gelöst und die beschriebenen Wirkungen erhalten.

Gegenstand der Erfindung ist die Verwendung von einer Verbindung oder mehrerer Verbindungen aus der Gruppe der Ectoine als Radikalfänger und/oder Antioxidantien sowie ihre Verwendung zur Behandlung und/oder Prophylaxe der durch oxidative Beanspruchung hervorgerufenen Hautalterung und von entzündlichen Reaktionen.

Gegenstand der Erfindung ist auch die Verwendung von Ectoinen als Antioxidantien und/oder als Radikalfänger als Bestandteil von kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen.

Bevorzugt wird die Verwendung von Ectoinen und Zubereitungen damit, zur Verhinderung von UV-induzierten Schäden der Haut vorzugsweise von UVA-Strahlung, insbesondere von UVA1 induzierten Schäden und insbesondere solcher, die durch die von UV-Strahlung hervorgerufenen reaktiven Sauerstoffspezies sowie anderer radikalischer oder prooxidativer Prozesse bedingt sind.

Auch die vorstehend genannten Verwendungen sind Gegenstand der Erfindung. Das Ectoin und Ectoinderivate werden hier auch als Ectoine bezeichnet.

Geeignete Ectoine sind Ectoin (Racemat) (1,4,5,6-Tetrahydro-2-methyl-4-pyrimidincarbonsäure oder 3,4,5,6-Tetrahydro-2-methyl-4-pyrimidincarbonsäure) oder 5-Hydroxy-Ectoin (Racemat), bzw. Hydroxyectoin (1,4,5,6-Tetrahydro-5-hydroxy-2-methyl-4-pyrimidincarbonsäure oder 3,4,5,6-Tetrahydro-5-hydroxy-2-methyl-4-pyrimidincarbonsäure).

Bevorzugt werden Ectoin, (S)-1,4,5,6-Tetrahydro-2-methyl-4-pyrimidincarbonsäure und/oder (S, S)-1,4,5,6-Tetrahydro-5-hydroxy-2-methyl-4-pyrimidincarbonsäure (5-Hydroxy-Ectoin bzw. Hydroxyectoin).

Weitere geeignete Ectoine sind Derivate von Ectoin oder 5-Hydroxy-Ectoin (sie werden auch THP (A) oder THP (B) benannt) sowie auch deren Isomere und Tetrahydro-4-pyrimidincarbonsäure-Derivate, die hier auch als Ectoine bezeichnet werden.

Die Ectoine sind bekannt, im Handel erhältlich und nach bekannten Verfahren herzustellen. Sie können als Racemat oder in optisch aktiver Form vorliegen. Die S-Isomeren werden bevorzugt. Ectoine können auch Diastereomere, Zwitterionen, Kationen oder Anionen bilden.

Bevorzugte Ectoinderivate sind Salze, z. B. Natrium- oder Kaliumsalze der Ectoine oder Ester, die durch Umsetzung der 4-Carboxygruppe mit Alkoholen und/oder der 5-Hydroxygruppe mit Carbonsäuren erhalten werden können, oder Säureadditionssalze mit anorganischen oder organischen Säuren.

Geeignet sind beispielsweise geradkettige oder verzweigte Monoalkohole mit 1 bis 20 Kohlenstoffatomen oder geradkettige oder verzweigte Alkylcarbonsäuren mit 2 bis 20 Kohlenstoffatomen, z. B. Alkylmonocarbonsäuren.

Vorzugsweise besitzen die Alkylreste der genannten Alkohole oder Carbonsäuren jeweils bis zu 10 Kohlenstoffatome, insbesondere bis zu 5 Kohlenstoffatome.

Gegebenenfalls besitzen die Monoalkohole eine weitere Hydroxygruppe und die Monocarbonsäuren eine weitere Carboxylgruppe.

DE 199 33 466 A 1

Die erfindungsgemäßen kosmetischen oder dermatologischen Formulierungen können wie üblich zusammengesetzt sein und zur Behandlung, der Pflege und der Reinigung der Haut und/oder der Haare und als Schminkprodukt in der dekorativen Kosmetik dienen. Sie enthalten bevorzugt 0,01 Gew.-% bis 10 Gew.-%, bevorzugt 0,05 Gew.-% bis 5 Gew.-%, insbesondere 0,1–2,0 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht des Mittels, an Ectoinen. Zur Anwendung werden die erfindungsgemäßen kosmetischen und dermatologischen Zubereitungen in der für Kosmetika üblichen Weise auf die Haut und/oder die Haare in ausreichender Menge aufgebracht.

Erfindungsgemäße kosmetische und dermatologische Zubereitungen können in verschiedenen Formen vorliegen. So können sie z. B. eine Lösung, eine wasserfreie Zubereitung, eine Emulsion oder Mikroemulsion vom Typ Wasser-in-Öl (W/O) oder vom Typ Öl-in-Wasser (O/W), eine multiple Emulsionen, beispielsweise vom Typ Wasser-in-Öl-in-Wasser (W/O/W), ein Gel, einen festen Stift, eine Salbe oder auch ein Aerosol darstellen. Es ist auch vorteilhaft, Ectoine in verkapselter Form darzureichen, z. B. in Kollagenmatrices und anderen üblichen Verkapselungsmaterialien, z. B. als Celluloseverkapselungen, in Gelatine, Wachsmatrices oder liposomal verkapselt. Insbesondere Wachsmatrices wie sie in der DE-OS 4308282 beschrieben werden, haben sich als günstig herausgestellt.

Es ist auch möglich und vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung, Ectoine in wäßrige Systeme bzw. Tensidzubereitungen zur Reinigung der Haut und der Haare einzufügen.

Als vorteilhafte Verkörperung der vorliegenden Erfindung wird daher auch die Verwendung von Ectoinen zum Schutze der Haut und/oder der Haare vor oxidativer Beanspruchung angesehen, insbesondere diese Verwendung der Ectoine in Shampoos und Waschformulierungen oder Haarbehandlungsmitteln, insbesondere Haarfärbemitteln.

Die erfindungsgemäßen kosmetischen und dermatologischen Zubereitungen können kosmetische Hilfsstoffe enthalten, wie sie üblicherweise in solchen Zubereitungen verwendet werden, z. B. Konservierungsmittel, Bakterizide, Parfüme, Substanzen zum Verhindern des Schäumens, Farbstoffe, Pigmente, die eine färbende Wirkung haben, Verdickungsmittel, oberflächenaktive Substanzen, Emulgatoren, weichmachende, anfeuchtende und/oder feuchthaltende Substanzen, Fette, Öle, Wachse oder andere übliche Bestandteile einer kosmetischen oder dermatologischen Formulierung wie Alkohole, Polyole, Polymere, Schaumstabilisatoren, Elektrolyte, organische Lösemittel oder Silikonderivate.

Insbesondere können Ectoine erfindungsgemäß auch mit anderen Antioxidantien und/oder Radikalfängern kombiniert werden.

Erfindungsgemäß können als günstige Antioxidantien alle für kosmetische und/oder dermatologische Anwendungen geeigneten oder gebräuchlichen Antioxidantien verwendet werden.

Vorteilhaft werden die Antioxidantien gewählt aus der Gruppe bestehend aus Aminosäuren (z. B. Glycin, Histidin, Tyrosin, Tryptophan) und deren Derivate, Imidazole (z. B. Urocaninsäure) und deren Derivate, Peptide wie D,L-Carnosin, D-Carnosin, L-Carnosin und deren Derivate (z. B. Anserin), Carotinoide, Carotine (z. B. α -Carotin, β -Carotin, Lycopin) und deren Derivate, Chlorogensäure und deren Derivate, Liponsäure und deren Derivate (z. B. Dihydroliponsäure), Aurothioglucoose, Propylthiouracil und andere Thiole (z. B. Thioredoxin, Glutathion, Cystein, Cystin, Cystamin und deren Glycosyl-, N-Acetyl-, Methyl-, Ethyl-, Propyl-, Amyl-, Butyl- und Lauryl-, Palmitoyl-, Oleyl-, γ -Linoleyl-, Cholesteryl- und Glycerylester) sowie deren Salze, Dilaurylthiodipropionat, Distearylthiodipropionat, Thiodipropionsäure und deren Derivate (Ester, Ether, Peptide, Lipide, Nukleotide, Nukleoside und Salze), Flavonoide, z. B. Quercetin, Rutin, Flavanol, ferner (Metall)-Chelatoren (z. B. α -hydroxyfettsäuren, Palmitinsäure, Phytinsäure, Lactoferrin), α -Hydroxysäuren (z. B. Citronensäure, Milchsäure, Apfelsäure), Huminsäure, Gallensäure, Gallenextrakte, Bilirubin, Biliverdin, EDTA, EGTA und deren Derivate, ungesättigte Fettsäuren und deren Derivate (z. B. γ -Linolensäure, Linolsäure, Ölsäure), Folsäure und deren Derivate, Ubichinon und Ubichinol und deren Derivate, Vitamin C und Derivate (z. B. Ascorbylpalmitat, Mg-Ascorbylphosphat, Ascorbylacetat), Tocopherole und Derivate (z. B. Vitamin-E-acetat), Vitamin A und Derivate (Vitamin-A-palmitat) sowie Koniferylbenzoat des Benzoecharzes, Rutinsäure und deren Derivate, Butylhydroxytoluol, Butylhydroxyanisol, Nordihydroguajakharzsäure, Nordihydroguajaretsäure, Trihydroxybutyrophenon, Harnsäure und deren Derivate, Mannose und deren Derivate, Sesamol, Sesamolin, Zink und dessen Derivate (z. B. ZnO, ZnSO₄) Selen und dessen Derivate (z. B. Selenmethionin), Stilbene und deren Derivate (z. B. Stilbenoxid, Trans-Stilbenoxid) und die erfindungsgemäß geeigneten Derivate (Salze, Ester, Ether, Zucker, Nukleotide, Nukleoside, Peptide und Lipide) dieser genannten Wirkstoffe.

Die Menge der vorgenannten Antioxidantien (eine oder mehrere Verbindungen) in den Zubereitungen beträgt vorzugsweise 0,001 bis 30 Gew.-%, besonders bevorzugt 0,05–20 Gew.-%, insbesondere 1–10 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung.

Sofern Vitamin E und/oder dessen Derivate das oder die zusätzlichen Antioxidantien darstellen, ist vorteilhaft, deren jeweilige Konzentrationen aus dem Bereich von 0,001–10 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Formulierung, zu wählen.

Sofern Vitamin A, bzw. Vitamin-A-Derivate, bzw. Carotine bzw. deren Derivate das oder die zusätzlichen Antioxidantien darstellen, ist vorteilhaft, deren jeweilige Konzentrationen aus dem Bereich von 0,001–10 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Formulierung, zu wählen.

Erfindungsgemäße Emulsionen sind vorteilhaft und enthalten z. B. die genannten Fette, Öle, Wachse und anderen Fettkörper, sowie Wasser und einen Emulgator, wie er üblicherweise für einen solchen Typ der Formulierung verwendet wird.

Die Lipidphase kann vorteilhaft gewählt werden aus folgender Substanzgruppe:

- Mineralöle, Mineralwachse
- Öle, wie Triglyceride der Caprin- oder der Caprylsäure, ferner natürliche Öle wie z. B. Rizinusöl;
- Fette, Wachse und andere natürliche und synthetische Fettkörper, vorzugsweise Ester von Fettsäuren mit Alkoholen niedriger C-Zahl, z. B. mit Isopropanol, Propyleryglykol oder Glycerin, oder Ester von Fettalkoholen mit Alkansäuren niedriger C-Zahl oder mit Fettsäuren;
- Alkylbenzoate;
- Silikonöle wie Dimethylpolysiloxane, Diethylpolysiloxane, Diphenylpolysiloxane sowie Mischformen daraus.

DE 199 33 466 A 1

Die Ölphase der Emulsionen, Oleogele bzw. Hydrodispersionen oder Lipodispersionen im Sinne der vorliegenden Erfindung wird vorteilhaft gewählt aus der Gruppe der Ester aus gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkancarbonsäuren einer Kettenlänge von 3 bis 30 C-Atomen und gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkoholen einer Kettenlänge von 3 bis 30 C-Atomen, aus der Gruppe der Ester aus aromatischen Carbonsäuren und gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkoholen einer Kettenlänge von 3 bis 30 C-Atomen. Solche Esteröle können dann vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe Isopropylmyristat, Isopropylpalmitat, Isopropylstearat, Isopropyloleat, n-Butylstearat, n-Hexyllaurat, n-Decyloleat, Isooctylstearat, Isononylstearat, Isononylisononanoat, 2-Ethylhexylpalmitat, 2-Ethylhexyllaurat, 2-Hexyldecylstearat, 2-Octyldodecylpalmitat, Oleyloleat, Oleylerucat, Erucyloleat, Erucylerucat sowie synthetische, halbsynthetische und natürliche Gemische solcher Ester, z. B. Jojobaöl.

Ferner kann die Ölphase vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe der verzweigten und unverzweigten Kohlenwasserstoffe und -wachse, der Silikonöle, der Dialkylether, der Gruppe der gesättigten oder ungesättigten, verzweigten oder unverzweigten Alkohole, sowie der Fettsäuretriglyceride, namentlich der Triglycerinester gesättigter und/oder ungesättigter, verzweigter und/oder unverzweigter Alkancarbonsäuren einer Kettenlänge von 8 bis 24, insbesondere 12–18 C-Atomen. Die Fettsäuretriglyceride können beispielsweise vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe der synthetischen, halbsynthetischen und natürlichen Öle, z. B. Olivenöl, Sonnenblumenöl, Sojaöl, Erdnußöl, Rapsöl, Mandelöl, Palmöl, Kokosöl, Palmkernöl und dergleichen mehr.

Auch beliebige Abmischungen solcher Öl- und Wachskomponenten sind vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung einzusetzen. Es kann auch gegebenenfalls vorteilhaft sein, Wachse, beispielsweise Cetylpalmitat, als alleinige Lipidkomponente der Ölphase einzusetzen.

Vorteilhaft wird die Ölphase gewählt aus der Gruppe 2-Ethylhexylisostearat, Octyldodecanol, Isotridecylisononanoat, Isoeicosan, 2-Ethylhexylcocoat, C₁₂₋₁₅-Alkylbenzoat, Capryl-Caprinsäure-triglycerid, Dicaprylylether.

Besonders vorteilhaft sind Mischungen aus C₁₂₋₁₅-Alkylbenzoat und 2-Ethylhexylisostearat, Mischungen aus C₁₂₋₁₅-Alkylbenzoat und Isotridecylisononanoat sowie Mischungen aus C₁₂₋₁₅-Alkylbenzoat, 2-Ethylhexylisostearat und Isotridecylisononanoat.

Von den Kohlenwasserstoffen sind Paraffinöl, Squalan und Squalen vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung zu verwenden.

Vorteilhaft kann die Ölphase ferner einen Gehalt an cyclischen oder linearen Silikonölen aufweisen oder vollständig aus solchen Ölen bestehen, wobei allerdings bevorzugt wird, außer dem Silikonöl oder den Silikonölen einen zusätzlichen Gehalt an anderen Ölphasenkomponenten zu verwenden.

Vorteilhaft wird Cyclomethicon (Octamethylcyclotetrasiloxan) als erfindungsgemäß zu verwendendes Silikonöl eingesetzt. Aber auch andere Silikonöle sind vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung zu verwenden, beispielsweise Hexamethylcyclotrisiloxan, Polydimethylsiloxan, Poly(methylphenylsiloxan).

Besonders vorteilhaft sind ferner Mischungen aus Cyclomethicon und Isotridecylisononanoat, aus Cyclomethicon und 2-Ethylhexylisostearat.

Die wäßrige Phase der erfindungsgemäßen Zubereitungen enthält gegebenenfalls neben Wasser vorteilhaft Alkohole, Diöle oder Polyole niedriger C-Zahl, sowie deren Ether, vorzugsweise Ethanol, Isopropanol, Propylenglykol, Glycerin, Ethylenglykol, Ethylenglykolmonoethyl- oder -monobutylether, Propylenglykolmonomethyl-, -monoethyl- oder -monobutylether, Diethylenglykolmonomethyl- oder -monoethylether und analoge Produkte, ferner Alkohole niedriger C-Zahl, z. B. Ethanol, Isopropanol, 1,2-Propandiol, Glycerin sowie insbesondere ein oder mehrere Verdickungsmittel, welches oder welche vorteilhaft gewählt werden können aus der Gruppe Siliciumdioxid, Aluminiumsilikate, Polysaccharide bzw. deren Derivate, z. B. Hyaluronsäure, Xanthangummi, Hydroxypropylmethylcellulose, besonders vorteilhaft aus der Gruppe der Polyacrylate, bevorzugt ein Polyacrylat aus der Gruppe der sogenannten Carbopole, beispielsweise Carbopole der Typen 980, 981, 1382, 2984, 5984, jeweils einzeln oder in Kombination.

Insbesondere werden Gemische der vorstehend genannten Lösemittel verwendet. Bei alkoholischen Lösemitteln kann Wasser ein weiterer Bestandteil sein.

Erfindungsgemäße Emulsionen sind vorteilhaft und enthalten z. B. die genannten Fette, Öle, Wachse und anderen Fettkörper, sowie Wasser und einen Emulgator, wie er üblicherweise für einen solchen Typ der Formulierung verwendet wird.

Gele gemäß der Erfindung enthalten üblicherweise Alkohole niedriger C-Zahl, z. B. Ethanol, Isopropanol, 1,2-Propandiol, Glycerin und Wasser bzw. ein vorstehend genanntes Öl in Gegenwart eines Verdickungsmittels, das bei ölig-alkoholischen Gelen vorzugsweise Siliciumdioxid oder ein Aluminiumsilikat, bei wäßrig-alkoholischen oder alkoholischen Gelen vorzugsweise ein Polyacrylat ist.

Als Treibmittel für erfindungsgemäße, aus Aerosolbehältern versprühbare Zubereitungen sind die üblichen bekannten leichtflüchtigen, verflüssigten Treibmittel, beispielsweise Kohlenwasserstoffe (Propan, Butan, Isobutan) geeignet, die allein oder in Mischung miteinander eingesetzt werden können. Auch Druckluft ist vorteilhaft zu verwenden.

Vorteilhaft können erfindungsgemäße Zubereitungen außerdem Substanzen enthalten, die UV-Strahlung im UVB-Bereich absorbieren, wobei die Gesamtmenge der Filtersubstanzen z. B. 0,1 Gew.-% bis 30 Gew.-%, vorzugsweise 0,5 bis 10 Gew.-%, insbesondere 1,0 bis 6,0 Gew.-% beträgt, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen, um kosmetische Zubereitungen zur Verfügung zu stellen, die das Haar bzw. die Haut vor dem gesamten Bereich der ultravioletten Strahlung schützen. Sie können auch als Sonnenschutzmittel fürs Haar oder die Haut dienen.

Enthalten die erfindungsgemäßen Zubereitungen UVB-Filtersubstanzen, können diese öllöslich oder wasserlöslich sein. Erfindungsgemäß vorteilhafte öllösliche UVB-Filter sind z. B.:

- 3-Benzylidencampher-Derivate, vorzugsweise 3-(4-Methylbenzyliden)campher, 3-Benzylidencampher;
- 4-Aminobenzoessäure-Derivate, vorzugsweise 4-(Dimethylamino)-benzoessäure(2-ethylhexyl)ester, 4-(Dimethylamino)benzoessäureamylester;

DE 199 33 466 A 1

- Ester der Zimtsäure, vorzugsweise 4-Methoxyzimtsäure(2-ethylhexyl)ester, 4-Methoxyzimtsäureisopentylester;
- Ester der Salicylsäure, vorzugsweise Salicylsäure(2-ethylhexyl)ester, Salicylsäure(4-isopropylbenzyl)ester, Salicylsäurehomomenthylester,
- Derivate des Benzophenons, vorzugsweise 2-Hydroxy-4-methoxybenzophenon, 2-Hydroxy-4-methoxy-4'-methylbenzophenon, 2,2'-Dihydroxy-4-methoxybenzophenon;
- Ester der Benzalmalonsäure, vorzugsweise 4-Methoxybenzalmalonsäuredi(2-ethylhexyl)ester, - 2,4,6-Triänilino-(p-carbo-2'-ethyl-1'-hexyloxy) - 1,3,5-triazin.
- Derivate des Benzotriazols
- an Polymere des Acrylates oder des Silikons gebundene Chromophore
- Symmetrisch und unsymmetrisch substituierte Triazine

Vorteilhafte wasserlösliche UVB-Filter sind z. B.:

- Salze der 2-Phenylbenzimidazol-5-sulfonsäure wie ihr Natrium-, Kalium- oder ihr Triethanolammonium-Salz, sowie die Sulfonsäure selbst;
- Sulfonsäure-Derivate von Benzophenonen, vorzugsweise 2-Hydroxy-4-methoxybenzophenon-5-sulfonsäure und ihre Salze;
- Sulfonsäure-Derivate des 3-Benzylidencamphers, wie z. B. 4-(2-Oxo-3-bornylidenmethyl)benzolsulfonsäure, 2-Methyl-5-(2-oxo-3-bornylidenmethyl)sulfonsäure und ihre Salze sowie das 1,4-di(2-oxo-10-Sulfo-3-bornylidenmethyl)-Benzol und dessen Salze (die entsprechenden 10-Sulfato-Verbindungen, beispielsweise das entsprechende Natrium-, Kalium- oder Triethanolammonium-Salz), auch als Benzol-1,4-di(2-oxo-3-bornylidenmethyl-10-Sulfonsäure bezeichnet

Die Liste der genannten UVB-Filter, die in Kombination mit den erfindungsgemäßen Wirkstoffkombinationen verwendet werden können, soll selbstverständlich nicht limitierend sein.

Gegenstand der Erfindung ist auch die Verwendung einer Kombination der Ectoine mit mindestens einem UVB-Filter als Antioxidantien bzw. die Verwendung einer Kombination der Ectoine mit mindestens einem UVB-Filter als Antioxidantien in einer kosmetischen oder dermatologischen Zubereitung.

Es kann auch von Vorteil sein, Ectoine mit UVA-Filtern zu kombinieren, die bisher üblicherweise in kosmetischen Zubereitungen enthalten sind. Bei diesen Substanzen handelt es sich vorzugsweise um Derivate des Dibenzoylmethans, insbesondere um 1-(4'-tert-Butylphenyl)-3-(4'-methoxyphenyl)propan-1,3-dion und um 1-Phenyl-3-(4'-isopropylphenyl)propan-1,3-dion. Auch diese Kombinationen bzw. Zubereitungen, die diese Kombinationen enthalten, sind Gegenstand der Erfindung. Es können die für die UVB-Kombination verwendeten Mengen eingesetzt werden.

Gegenstand der Erfindung ist auch die Verwendung einer Kombination von Ectoinen mit mindestens einem UVA-Filter als Antioxidans bzw. die Verwendung einer Kombination der erfindungsgemäßen Wirkstoffkombinationen mit mindestens einem UVA-Filter als Antioxidans in einer kosmetischen oder dermatologischen Zubereitung.

Gegenstand der Erfindung ist auch die Verwendung einer Kombination aus Ectoinen mit mindestens einem UVA-Filter und mindestens einem UVB-Filter als Antioxidans bzw. die Verwendung einer Kombination aus Ectoinen mit mindestens einem UVA-Filter und mindestens einem UVB-Filter als Antioxidans in einer kosmetischen oder dermatologischen Zubereitung.

Kosmetische und dermatologische Zubereitungen mit einem wirksamen Gehalt an Ectoinen können auch anorganische Pigmente enthalten, die üblicherweise in der Kosmetik zum Schutze der Haut vor UV-Strahlen verwendet werden. Dabei handelt es sich um Oxide des Titans, Zinks, Zirkoniums, Siliciums, Mangans, Cers und Mischungen davon, sowie Abwandlungen, bei denen die Oxide die aktiven Agentien sind. Besonders bevorzugt handelt es sich um Pigmente auf der Basis von Titandioxid.

Auch diese Kombinationen von UVA-Filter und Pigment bzw. Zubereitungen, die diese Kombination enthalten, sind Gegenstand der Erfindung. Es können die für die vorstehenden Kombinationen genannten Mengen verwendet werden.

Bei kosmetischen und dermatologischen Zubereitungen zum Schutze der Haare vor UV-Strahlen gemäß der Erfindung handelt es sich beispielsweise um Shampooierungsmittel, Zubereitungen, die beim Spülen der Haare vor oder nach der Shampooierung, vor oder nach der Dauerwellbehandlung, vor oder nach der Färbung oder Entfärbung der Haare angewendet werden, um Zubereitungen zum Föhnen oder Einlegen der Haare Zubereitungen zum Färben oder Entfärben, um eine Frisier- und Behandlungslotion, einer Haarlack oder um Dauerwellmittel.

Die kosmetischen und dermatologischen Zubereitungen enthalten Wirkstoffe und Hilfsstoffe, wie sie üblicherweise für diesen Typ von Zubereitungen zur Haarpflege und Haarbehandlung verwendet werden. Als Hilfsstoffe dienen Konservierungsmittel, oberflächenaktive Substanzen, Substanzen zum Verhindern des Schäumens, Verdickungsmittel, Emulgatoren, Fette, Öle, Wachse, organische Lösungsmittel, Bakterizide, Parfüme, Farbstoffe oder Pigmente, deren Aufgabe es ist, die Haare oder die kosmetische oder dermatologische Zubereitung selbst zu färben, Elektroyte, Substanzen gegen das Fetten der Haare.

Unter Elektrolyten im Sinne der vorliegenden Erfindung sind wasserlösliche Alkali-, Ammonium-, Erdalkali- (unter Einbeziehung des Magnesiums) und Zinksalze anorganischer Anionen und beliebige Gemische aus solchen Salzen zu verstehen, wobei gewährleistet sein muß, daß sich diese Salze durch pharmazeutische oder kosmetische Unbedenklichkeit auszeichnen.

Die erfindungsgemäßen Anionen werden bevorzugt gewählt aus der Gruppe der Chloride, der Sulfate und Hydrogensulfate, der Phosphate, Hydrogenphosphate und der linearen und cyclischen Oligophosphate sowie der Carbonate und Hydrogencarbonate.

Kosmetische Zubereitungen, die ein Hautreinigungsmittel oder Shampooierungsmittel darstellen, enthalten vorzugsweise mindestens eine anionische, nicht-ionische oder amphotere oberflächenaktive Substanz, oder auch Gemische aus solchen Substanzen, Ectoine im wäßrigen Medium und Hilfsmittel, wie sie üblicherweise dafür verwendet werden. Die

DE 199 33 466 A 1

oberflächenaktive Substanz bzw. die Gemische aus diesen Substanzen können in einer Konzentration zwischen 1 Gew.-% und 50 Gew.-% in dem Shampooierungsmittel vorliegen.

Liegen die kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen in Form einer Lotion vor, die ausgespült und z. B. vor oder nach der Entfärbung, vor oder nach der Shampooierung, zwischen zwei Shampooierungsschritten, vor oder nach der Dauerwellbehandlung angewendet wird, so handelt es sich dabei z. B. um wäßrige oder wäßrig-alkoholische Lösungen, die gegebenenfalls oberflächenaktive Substanzen enthalten, deren Konzentration zwischen 0,1 und 10 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 0,2 und 5 Gew.-%, liegen kann.

Diese kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen können auch Aerosole mit den üblicherweise dafür verwendeten Hilfsmitteln darstellen.

Eine kosmetische Zubereitung in Form einer Lotion, die nicht ausgespült wird, insbesondere eine Lotion zum Einlegen der Haare, eine Lotion, die beim Fönen der Haare verwendet wird, eine Frisier- und Behandlungslotion, stellt im allgemeinen eine wäßrige, alkoholische oder wäßrig-alkoholische Lösung dar und enthält mindestens ein kationisches, anionisches, nicht-ionisches oder amphoter Polymer oder auch Gemische derselben, sowie Ectoine in wirksamer Konzentration. Die Menge der verwendeten Polymeren liegt z. B. zwischen 0,1 und 10 Gew.-%, bevorzugt zwischen 0,1 und 3 Gew.-%.

Kosmetische Zubereitungen zur Behandlung und Pflege der Haare, die Ectoine enthalten, können als Emulsionen vorliegen, die vom nicht-ionischen oder anionischen Typ sind. Nicht-ionische Emulsionen enthalten neben Wasser Öle oder Fettalkohole, die beispielsweise auch polyethoxyliert oder polypropoxyliert sein können, oder auch Gemische aus den beiden organischen Komponenten. Diese Emulsionen enthalten gegebenenfalls kationische oberflächenaktive Substanzen.

Erfindungsgemäß können kosmetische Zubereitungen zur Behandlung und Pflege der Haare als Gele vorliegen, die neben einem wirksamen Gehalt an Ectoinen und dafür üblicherweise verwendeten Lösungsmitteln, bevorzugt Wasser, noch organische Verdickungsmittel, z. B. Gummiarabikum, Xanthangummi, Natriumalginat, Cellulose-Derivate, vorzugsweise Methylcellulose, Hydroxymethylcellulose, Hydroxyethylcellulose, Hydroxypropylcellulose, Hydroxypropylmethylcellulose oder anorganische Verdickungsmittel, z. B. Aluminiumsilikate wie beispielsweise Bentonite, oder ein Gemisch aus Polyethylenglykol und Polyethylenglycolstearat oder -distearat, enthalten. Das Verdickungsmittel ist in dem Gel z. B. in einer Menge zwischen 0,1 und 30 Gew.-%, bevorzugt zwischen 0,5 und 15 Gew.-%, enthalten.

Vorzugsweise beträgt die Menge an Ectoinen in einem für die Haare bestimmten Mittel 0,05 Gew.-% bis 10 Gew.-%, insbesondere 0,5 Gew.-% bis 5 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht des Mittels.

Erfindungsgemäße wäßrige kosmetische Reinigungsmittel oder für die wäßrige Reinigung bestimmte wasserarme oder wasserfreie Reinigungsmittelkonzentrate können anionische, nichtionische und/oder amphotere Tenside enthalten, beispielsweise

- herkömmliche Seifen, z. B. Fettsäuresalze des Natriums
- Alkylsulfate, Alkylethersulfate, Alkan- und Alkylbenzolsulfonate
- Sulfoacetate
- Sulfobetaine
- Sarcosinate
- Amidosulfobetaine
- Sulfosuccinate
- Sulfobetaine
- Alkylethercarboxylate
- Eiweiß-Fettsäure-Kondensate
- Alkylbetaine und Amidobetaine
- Fettsäurealkanolamide
- Polyglycoether-Derivate

Kosmetische Zubereitungen, die kosmetische Reinigungszubereitungen für die Haut darstellen, können in flüssiger oder fester Form vorliegen. Sie enthalten neben Ectoinen vorzugsweise mindestens eine anionische, nicht-ionische oder amphotere oberflächenaktive Substanz oder Gemische daraus, gewünschtenfalls einen oder mehrere Elektrolyten und Hilfsmittel, wie sie üblicherweise dafür verwendet werden. Die oberflächenaktive Substanz kann in einer Konzentration zwischen 1 und 94 Gew.-% in den Reinigungszubereitungen vorliegen, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen.

Kosmetische Zubereitungen, die ein Shampooierungsmittel darstellen, enthalten neben einem wirksamen Gehalt an Ectoinen vorzugsweise mindestens eine anionische, nichtionische oder amphotere oberflächenaktive Substanz oder Gemische daraus, gegebenenfalls einen erfindungsgemäßen Elektrolyten und Hilfsmittel, wie sie üblicherweise dafür verwendet werden. Die oberflächenaktive Substanz kann in einer Konzentration zwischen 1 Gew.-% und 94 Gew.-% in dem Shampooierungsmittel vorliegen.

Die erfindungsgemäßen Zusammensetzungen enthalten gegebenenfalls die in der Kosmetik üblichen Zusatzstoffe, beispielsweise Parfüm, Verdicker, Farbstoffe, Desodorantien, antimikrobielle Stoffe, rückfettende Agentien, Komplexbildungs- und Sequestrierungsagentien, Perlglanzagentien, Pflanzenextrakte, Vitamine, Wirkstoffe und dergleichen.

Die vorliegende Erfindung umfaßt auch ein kosmetisches Verfahren zum Schutze der Haut und der Haare vor oxidativen bzw. photooxidativen Prozessen, das dadurch gekennzeichnet ist, daß man ein kosmetisches Mittel, welches eine wirksame Konzentration an Ectoinen enthält, in ausreichender Menge auf die Haut oder Haare aufbringt.

Ebenso umfaßt die vorliegende Erfindung auch ein Verfahren zum Schutze kosmetischer oder dermatologischer Zubereitungen gegen Oxidation oder Photooxidation, wobei diese Zubereitungen z. B. Zubereitungen zur Behandlung und Pflege der Haare darstellen, insbesondere Haarfärbemittel, Haarlacke, Shampooierungsmittel, Farbschampooierungsmittel, ferner Schminkprodukte wie z. B. Nagellacke, Lippenstifte, Teintgrundlagen, Wasch- und Duschzubereitungen,

DE 199 33 466 A 1

Cremes zur Behandlung oder Pflege der Haut oder um sämtliche anderen kosmetischen Zubereitungen handelt, deren Bestandteile Stabilitätsprobleme aufgrund von Oxidation bzw. Photooxidation bei der Lagerung mit sich bringen können, dadurch gekennzeichnet, daß die kosmetischen Zubereitungen einen wirksamen Gehalt an Ectoinen aufweisen.

Vorzugsweise beträgt die Menge an Ectoinen in diesen Zubereitungen 0,01–10 Gew.-%, bevorzugt 0,05–5 Gew.-%, insbesondere 0,1–2,0 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen.

Ectoine können in bekannter Weise in die erfindungsgemäßen Zubereitungen eingearbeitet werden. Ectoin und Hydroxy-Ectoin können z. B. in die Wasserphase, öllösliche Derivate z. B. in die Ölphase eingearbeitet werden. Weiterhin können die Ectoine den fertiger Zubereitungen zugemischt werden.

Gegenstand der Erfindung ist auch das Verfahren zur Herstellung der erfindungsgemäßen kosmetischen Mittel, das dadurch gekennzeichnet ist, daß man in an sich bekannter Weise erfindungsgemäßen Wirkstoffe oder Wirkstoffkombinationen in kosmetische und dermatologische Formulierungen einarbeitet.

Mengenangaben, Anteile und Prozentanteile sind, soweit nicht anders angegeben, auf das Gewicht und die Gesamtmenge bzw. auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen bezogen. Die nachfolgenden Beispiele sollen die vorliegende Erfindung verdeutlichen, ohne sie einzuschränken.

Beispiel 1

O/W-Lotion

	Gew.-%
Paraffinöl (DAB 9)	8,00
Isopropylpalmitat	3,00
Petrofatum	4,00
Cetylstearylalkohol	2,00
PEG 40 Rizinusöl	0,50
Natriumcetylstearylsulfat	0,50
Natrium Carbomer	0,40
Ectoin	0,50
Glycerin	3,00
α -Tocopherol	0,20
Octylmethoxycinnamat	5,00
Butylmethoxydibenzoylmethan	1,00
Konservierungsmittel, Farbstoffe, Parfüm	q.s.
Wasser	ad 100,00

Beispiel 2

O/W-Creme

	Gew.-%
Paraffinöl(DAB 9)	7,00
Avocadoöl	4,00
Glycerylmonostearat	2,00
Hydroxyectoin	0,50
Titandioxid	1,00
Natriumlactat	3,00
Glycerin	3,00
Konservierungsmittel, Farbstoffe, Parfüm	q.s.
Wasser	ad 100,00

Beispiel 3

Liposomenhaltiges Gel

	Gew.-%
Lecithin	6,00
Schibutter	3,00
Hydroxyectoin	0,50
α -Tocopherol	0,20
Biotin	0,08
Natriumcitrat	0,50
Glycin	0,20
Harnstoff	0,20
Natrium PCA	0,50
Hydrolysiertes Kollagen	2,00

DE 199 33 466 A 1

	Gew.-%	
Xanthan Gummi	1,40	
Sorbitol	3,00	
Konservierungsmittel, Farbstoffe, Parfüm	q.s.	
Wasser	ad 100,00	5

Beispiel 4

	Gew.-%	
Carbopol 934 P	2,00	
Triethanolamin	3,00	
Ectoin	0,50	
α -Tocopherylacetat	0,20	15
Polyoxyethylensorbitanfettsäureester (Tween 20)	0,50	
Glycerin	2,00	
Natrium PCA	0,50	
Hydrolisiertes Kollagen	2,00	
Konservierungsmittel, Farbstoffe, Parfüm	q.s.	20
Wasser	ad 100,00	

Beispiel 5

Sonnenschutzemulsion

	Gew.-%	
Cyclomethicon	2,00	
Cetyldimethicon Copolyol	0,20	30
PEG 22-Dodecyl Copolymer	3,00	
Paraffinöl (DAB 9)	2,00	
Caprylsäure-/Caprinsäure Triglycerid	5,80	
Octylmethoxycinnamat	5,80	
Butyl-methoxy-dibenzoylmethan	4,00	35
Hydroxyectoin	0,50	
α -Tocopherylacetat	0,50	
ZnSO ₄	0,70	
Na ₃ HEDTA	0,30	
Konservierungsmittel, Farbstoffe, Parfüm	q.s.	40
Wasser	ad 100,00	

Beispiel 6

Sonnenschutzemulsion

	Gew.-%	
Cyclomethicon	2,00	
Cetylstearylalkohol + PEG 40-hydriertes Rizinusöl +	2,50	50
Natrium Cetylstearylsulfat		
Glyceryllanolat	1,00	
Caprylsäure-/Caprinsäure Triglycerid	0,10	
Laurylmethicon Copolyol	2,00	
Octylstearat	3,00	55
Rizinusöl	4,00	
Glycerin	3,00	
Acrylamid/Natriumacrylat Copolymer	0,30	
Hydroxypropylmethylcellulose	0,30	
Octylmethoxycinnamat	5,00	60
Butyl-methoxy-dibenzoylmethan	0,50	
Ectoin	0,50	
α -Tocopherylacetat	1,00	
Na ₃ HEDTA	1,50	
Konservierungsmittel, Farbstoffe, Parfüm	q.s.	65
Wasser	ad 100,00	

DE 199 33 466 A 1

Beispiel 7

Sonnenschutzemulsion

	Gew.-%
5	
Cyclomethicone	2,00
Cetylstearylalkohol +PEG 40-hydriertes Rizinusöl +	2,50
Natrium Cetylstearylsulfat	
Glyceryllanolat	1,00
10	
Caprylsäure-/Caprinsäure Triglycerid	0,10
Laurylmethicon Copolyol	2,00
Octylstearat	3,00
Rizinusöl	4,00
Glycerin	3,00
15	
Acrylamid/Natriumacrylat Copolymer	0,30
Hydroxypropylmethylcellulose	0,30
Octylmethoxycinnamat	5,00
Butyl-methoxy-dibenzoylmethan	0,75
Ectoin	0,50
20	
Na3H EDTA	1,50
Konservierungsmittel, Farbstoffe, Parfüm	q.s.
Wasser	ad 100,00

Beispiel 8

Massagecreme

	Gew.-%
30	
Stearylalkohol	2,00
Petrolatum	4,00
Dimethicon	2,00
Isopropylpalmitat	6,00
Cetylstearylalkohol	4,00
35	
PEG-40 hydriertes Rizinusöl	2,00
α -Tocopherol	0,50
Hydroxyectoin	0,50
Glycerin	3,00
Konservierungsmittel, Farbstoffe, Parfüm	q.s.
40	
Wasser	ad 100,00

Beispiel 9

Haarwasser

	Gew.-%
45	
Ethanol	40,00
Diisopropyladipat	0,10
50	
PEG-40 hydriertes Rizinusöl	0,20
Ectoin	0,50
α -Tocopherylacetat	0,10
Konservierungsmittel, Farbstoffe, Parfüm	q.s.
55	
Wasser	ad 100,00

Beispiel 10

Sprayformulierung

	Gew.-%
60	
α -Tocopherol	0,10
Ectoin	0,50
Ethanol	28,20
65	
Konservierungsmittel, Farbstoffe, Parfüm	q.s.
Propan/Butan 25/75	ad 100,00

DE 199 33 466 A 1

Beispiel 11

O/W-Lotion

	Gew.-%	
Glycerylstearat SE	3,50	5
Stearinsäure	1,80	
Glycerin	3,00	
Cetylstearylalkohol	0,50	
Octyldodecanol	7,00	10
Dicaprylylether	8,00	
Uvinul®T150	3,00	
Aerosil	1,00	
Ectoin	1,00	
Carbomer	0,20	15
Natriumhydroxid (45%ig)	0,20	
Konservierungsmittel	q.s.	
Parfum	q.s.	
Wasser, demin.	ad 100,00	20

Beispiel 12

O/W-Lotion

	Gew.-%	
Glycerylstearat SE	3,00	25
Stearinsäure	2,00	
Glycerin	10,00	
Cetylstearylalkohol	0,50	30
Octyldodecanol	6,00	
Dicaprylylether	8,00	
Aerosil	0,50	
Hydroxyectoin	1,50	
Carbomer	0,20	35
Natriumhydroxid (45%ig)	0,20	
Konservierungsmittel	q.s.	
Parfum	q.s.	
Wasser, demin.	ad 100,00	40

Beispiel 13

Hydrodispersionsgel

	Gew.-%	
Pemulen®TR-1	0,50	45
Ethanol	3,50	
Glycerin	3,00	
Dimethicon	1,50	50
Octyldodecanol	0,50	
Capryl-Caprinsäuretriglycerid	5,00	
Ectoin	2,00	
Uvinul®T150	5,00	
Carbomer	0,20	55
Natriumhydroxid (45%ig)	0,55	
Konservierungsmittel	q.s.	
Parfum	q.s.	
Wasser, demin.	ad 100,00	60

Beispiel 14

Emulgatorfreie Sonnenlotion SPF 30

	Gew.-%	
Caprylic/Capric-Triglyceride	30,00	65

DE 199 33 466 A 1

	Gew.-%
Uvinul T150	4,00
Eusolex 6300	2,00
Neo Heliopan OS	5,00
5 Parsol 1789	2,00
Eusolex T2000	4,00
Aerosil R972	2,00
Ectoin	0,80
Zinkoxid Neutral Zinc Oxid	2,50
10 Natrosol Plus 330CS	0,50
Glycerin	10,00
Wasser	ad 100,00

Beispiel 15

15

O/W-Creme

	Gew.-%
Glycerylstearat SE	3,50
20 Stearinsäure	3,50
Butylenglykol	5,00
Cetylstearylalkohol	3,00
C ₁₂ -C ₁₅ Alkylbenzoate	10,00
Triazin, entsprechend	4,00
25 Anmeldung	
Aerosil®	3,00
Ectoin	2,00
Carbomer	0,20
Natriumhydroxid (45%ig)	0,35
30 Konservierungsmittel	q.s.
Parfum	q.s.
Wasser, demin.	ad 100,00

Beispiel 16

35

W/O-Lotion

	Gew.-%
40 Dehymuls®PGPH	3,50
Lameform®TGI	3,50
Butylenglykol	5,00
Ceresin	3,00
C ₁₂ -C ₁₅ Alkylbenzoate	10,00
45 Uvinul®T150	4,00
Hydroxyectoin	0,75
Vaseline	2,00
Natriumhydroxid (45%ig)	0,35
Konservierungsmittel	q.s.
50 Parfum	q.s.
Wasser, demin.	ad 100,00

Beispiel 17

55

O/W-Lotion

	Gew.-%
Glycerylstearat SE	3,50
60 Stearinsäure	1,80
Glycerin	3,00
Cetylstearylalkohol	0,50
Octyldodecanol	7,00
Dicaprylether	8,00
65 Uvinul®T150	3,00
Parsol®1789	2,00
Eusolex®6300	1,00

DE 199 33 466 A 1

	Gew.-%	
TiO ₂	2,00	
Ectoin	1,00	
Carbomer	0,20	
Natriumhydroxid (45%ig)	0,20	5
Konservierungsmittel	q.s.	
Parfum	q.s.	
Wasser, demin.	ad 100,00	

Beispiel 18 10

Hydrodispersionsgel

	Gew.-%	
Pemulen®TR-1	0,50	15
Ethanol	3,50	
Glycerin	3,00	
Dimethicon	1,50	
Octyldodecanol	0,50	
Capryl-Caprinsäuretriglycerid	5,00	20
Aerosil®	2,00	
Parsol®1789	2,00	
Eusoiex®6300	1,00	
Ectoin	0,90	
Carbomer	0,20	25
Natriumhydroxid (45%ig)	0,55	
Konservierungsmittel	q.s.	
Parfum	q.s.	
Wasser, demin.	ad 100,00	30

Beispiel 19

O/W-Creme

	Gew.-%	
Glycerylstearat SE	3,50	
Stearinsäure	3,50	
Butylenglykol	5,00	
Cetylstearylalkohol	3,00	40
C ₁₂ -C ₁₅ Alkylbenzoate	10,00	
Uvinul®T150	4,00	
Parsol®1789	2,00	
Eusolex®6300	1,00	
Ectoin	1,35	45
Carbomer	0,20	
Natriumhydroxid (45%ig)	0,35	
Konservierungsmittel	q.s.	
Parfum	q.s.	
Wasser, demin.	ad 100,00	50

Beispiel 20

W/O-Lotion

	Gew.-%	
Dehymuls®PGPH	3,50	
Lameform®TGI	3,50	
Butylenglykol	5,00	60
Ceresin	3,00	
C ₁₂ -C ₁₅ Alkylbenzoate	10,00	
Ectoin	1,20	
Parsol®1789	2,00	
Eusolex®6300	1,00	65
TiO ₂	2,00	
Vaseline	2,00	

DE 199 33 466 A 1

	Natriumhydroxid (45%ig)	Gew.-%
	Konservierungsmittel	0,35
	Parfum	q.s.
5	Wasser, demin.	q.s.
		ad 100,00

Patentansprüche

1. Verwendung von einer Verbindung oder mehreren Verbindungen aus der Gruppe der Ectoine als Antioxidantien und/oder als Radikalfänger.
2. Verwendung von einer Verbindung oder mehreren Verbindungen aus der Gruppe der Ectoine als Antioxidantien und/oder als Radikalfänger in kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen.
3. Verwendung von einer Verbindung oder mehreren Verbindungen aus der Gruppe der Ectoine als Radikalfänger und/oder Antioxidantien sowie ihre Verwendung zur Behandlung und/oder Prophylaxe der durch oxidative Beanspruchung hervorgerufenen Hautalterung und von entzündlichen Reaktionen.
4. Verwendung nach Anspruch 2, dadurch gekennzeichnet, daß die Ectoine in einem wirksamen Gehalt in kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen vorliegen.
5. Verwendung nach Anspruch 3, dadurch gekennzeichnet, daß die Ectoine in kosmetischen oder dermatologischen topischen Zubereitungen in Konzentrationen von 0,01–10 Gew.-%, bevorzugt 0,05–5 Gew.-%, insbesondere 0,1–2,0 Gew.-% bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen, vorliegen.

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning
Operations and is not part of the Official Record**

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- ☐ BLACK BORDERS
- ☐ IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- ☐ FADED TEXT OR DRAWING
- ☒ BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING
- ☐ SKEWED/SLANTED IMAGES
- ☐ COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS
- ☐ GRAY SCALE DOCUMENTS
- ☐ LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT
- ☐ REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY
- ☐ OTHER: _____

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.